

SZABADALMI
LEÍRÁS

B

A bejelentés napja: (22) 1983. 06. 30.

(21) 2382/83

A bejelentés elsőbbsége: (33) (32) (31)
DE: 82. 07. 01. (P 32 24 512.2)

A közzététel napja: (41) (42) 1984. 04. 30.

Megjelent: (45) 1988. XI. 30.

Nemzetközi
osztályjelzett:(51) NSZO,
C 07 D 471/04
C 07 D 235/18
C 07 D 473/00
A 61 K 31/415

Feltaláló(k): (72)

dr. HAUEL Norbert, dr. AUSTEL Volkhard, dr. REIFFEN Manfred,
dr. DIEDEREN Willi, Biberach, dr. HEIDER Joachim, Warthausen,
DE

Szabadalmas: (73)

dr. Karl Thomae GmbH., Biberach an der Riss, DE

(54)

ELJÁRÁS ÚJ IMIDAZOL-SZÁRMAZÉKOK ELŐÁLLÍTÁSÁRA

(57) KIVONAT

A találmány az (I) általános képletű új imidazol-származékoknak, ezek tautomerjeinek és savaddíciós sóinak előállítására vonatkozik; a képletben

A és B a közöttük levő két szénatommal együtt (a), (b), (c) vagy (d) képletű csoportot jelent; a csoportokban

R₄ hidrogén- vagy halogénatomot, alkil-, hidroxi-, alkoxi-, trifluor-metil-, ciano-, alkoxi-karbonil-, amino-karbonil-, alkil-amino-karbonil-, hidroxikarbonil-, nitro-, amino-, alkanoil-amino-, alkoxi-karbonil-amino-, amino-karbonil-amino-, alkil-amino-karbonil-amino-, alkán-szulfonil-aminocsoportot,

R₅ hidrogén- vagy halogénatomot, alkil- vagy alkoxicscsoportot, és

R₆ hidrogén- vagy halogénatomot vagy alkilcsoportot,

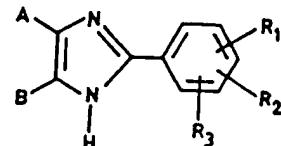
R₁ alkánszulfonil-oxi-, trifluor-metánszulfonil-oxi-, alkánszulfonil-amino-, N-alkil-alkánszulfonil-amino-, trifluor-metánszulfonil-amino-, N-alkil-trifluor-metánszulfonil-amino-, alkil-szulfenil-metil-, alkil-szulfinil-metil- vagy alkil-szulfonil-metilcsoportot, alkoxi-, amino-, alkil-amino- vagy dialkil-aminocscoporttal szubsztituált karbonilcsoportot, továbbá amino-, alkil-amino-, vagy morfolinocscoporttal szubsztituált szulfonilcsoportot, ha A és B (a), (b) vagy (d) csoport, nitro- vagy ciáncscoportot is,

R₂ alkil-, alkoxi- vagy dialkil-aminocscoportot és

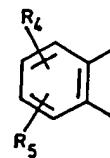
R₃ hidrogénatomot vagy alkoxicscsoportot jelent.

A fentiekben a helyettesítőkben lévő alkilcsoportok 1-2, 1-3, ill. 1-4 szénatomosak.

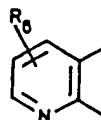
Az (I) általános képletű imidazol-származékokat hatóanyagként tartalmazó gyógyszerkészítmények különböző eredetű szívelégtelenségek kezelésére alkalmasak.



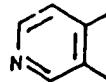
(I)



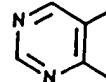
(a)



(b)



(c)



(d)

tóanyagot, a glicerint és a szacharin-nátriumot vizben oldva adjuk hozzá. Az oldatot végül tisztára szűrjük.

Szabadalmi igénypontok

1. Eljárás az (I) általános képletű imidazol-származékok – a képletben

A és B a közöttük levő két szénatommal együtt (a) vagy (b) általános képletű vagy (c) vagy (d) képletű csoportot jelent; a képletekben

R_4 hidrogén- vagy halogénatomot, alkil-, hidroxi-, alkoxi-, trifluor-metil-, ciano-, alkoxi-karbonil-, amino-karbonil-, alkil-amino-karbonil, hidroxi-alkil-, nitro-, amino-, alkanoil-amino-, alkoxi-karbonil-amino-, amino-karbonil-amino-, alkil-amino-karbonil-amino- vagy alkánsulfonil-amino-csoportot jelent;

R_5 hidrogén- vagy halogénatomot, alkil- vagy alkoxicsoportot jelent és

R_6 hidrogén- vagy halogénatomot vagy alkilcsoportot jelent, és az előzőekben említett alkilcsoportok 1–3 szénatomosak;

R_1 alkánsulfonil-oxi-, trifluor-metánsulfonil-oxi-, alkán-sulfonil-amino-, N-alkil-alkánsulfonil-amino-, trifluor-metánsulfonil-amino-, N-alkil-trifluor-metánsulfonil-amino-, alkil-sulfonil-metil-, alkil-sulfonil-metil- vagy alkil-sulfonil-metilcsoportot jelent; alkoxi-, amino-, alkil-amino- vagy dialkil-aminocsoporttal szubsztituált karbonilcsoportot jelent, amelyben megnevezett csoportok alkilrésze 1–3 szénatomos; továbbá amino-, dialkil-amino- vagy morfolinocsoporttal szubsztituált szulfonilcsoportot jelent, és a helyettesítőkben az alkilcsoport 1–2 szénatomos, továbbá 1–4 szénatomos alkil-amino-sulfonil-csoportot, és ha A és B (a) vagy (b) általános képletű csoport vagy (d) képletű csoport, nitro- vagy cianocsoportot is jelent;

R_2 1–3 szénatomos alkilcsoportot, az alkilrészben 1–2 szénatomos alkoxi- vagy dialkil-amino-csoportot és

R_3 hidrogénatomot vagy 1–3 szénatomos alkoxicsoportot jelent, tautomeriek és savaddíciós sóik – különösen szervetlen vagy szerves savakkal képzett, fiziológiaileg elviselhető savaddíciós sóik – előállítására *azzal-jellemezve*, hogy

a) adott esetben a reakcióegyenben képzett, valamely (II) általános képletű vegyületet – a képletben

A és B jelentése a tárgyi körben megadott, az X vagy Y jelképek közül az egyik hidrogénatomot jelent és a másik vagy az X és az Y jelképek minden egyike (i) általános képletű csoportot jelent, a képben

R_1 , R_2 és R_3 jelentése a tárgyi körben megadott,

Z_1 és Z_2 azonosak vagy egymástól eltérőek lehetnek, és adott esetben szubsztituált aminocsoportokat vagy adott esetben kis szénatomszámú alkilcsoportokkal szubsztituált hidroxi- vagy merkapto-csoportokat jelentenek vagy Z_1 és Z_2 együtt egy oxigén- vagy kénatomot, adott esetben 1–3 szénatomos alkilcsoporttal szubsztituált iminocsoportot, 2–3 szénatomos alkilén-dioxi- vagy alkilén-ditio-csoportot jelent – gyűrűsének vetünk alá, vagy

b) olyan (I) általános képletű vegyületek előállítására, amelyek képletében R_1 alkil-sulfonil-metil- vagy alkil-sulfonil-metilcsoportot jelent, A, B, R_2 és R_3 a tárgyi körben megadott, egy az a) eljárás szerint kapott (III) általános képletű vegyületet oxidálunk – a képletben

A, B, R_2 és R_3 jelentése a tárgyi körben megadott és R_1 olyan alkil-sulfonil-metil- vagy alkil-sulfonil-metilcsoportot jelent, amelyben az alkilrész 1–3 szénatomos – vagy

c) olyan (I) általános képletű vegyületek előállítására, amelyek képletében R_1 alkánsulfonil-oxi-, trifluor-metán-sulfonil-oxi-, alkánsulfonil-amino-, N-alkil-alkánsulfonil-amino-, trifluor-metánsulfonil-amino- vagy N-alkil-trifluor-metánsulfonil-amino-csoportot és/vagy R_4 alkánsulfonil-amino-csoportot jelent, A, B, R_2 és R_3 tárgyi körben megadott, egy (IV) általános képletű vegyületet – a képletben A, B, R_2 és R_3 jelentése a tárgyi körben megadott és R_1 hidroxi-, aminocsoportot vagy olyan N-alkil-aminocsoportot jelent, amelynek alkilrész 1–3 szénatomos és/vagy R_4 jelentése aminocsoport – egy (V) általános képletű szulfonsavval vagy reakcióképes származékával reagáltatjuk – a képletben R_1 1–3 szénatomos alkilcsoportot vagy trifluor-metilcsoportot jelent – vízelvonószer és/vagy a savat vagy az amint aktiváló szer jelenlétében vagy

d) Olyan (I) általános képletű vegyületek előállítására, amelyek képletében A, B, R_2 és R_3 a tárgyi körben megadott, R_1 amino-, alkil-amino- vagy dialkil-aminocsoporttal szubsztituált karbonilcsoportot vagy amino-, dialkil-amino- vagy morfolinocsoporttal szubsztituált szulfonilcsoportot vagy alkil-amino-sulfonilcsoportot és/vagy R_4 amino-karbonil- vagy alkil-amino-karbonil-csoportot jelent, egy (VI) általános képletű vegyületet – amely képletben R_2 , R_3 , A és B jelentése a tárgyi körben megadott és R_1 karboxil- vagy hidroxi-sulfonilcsoportot és/vagy R_4 karboxilcsoportot jelent – vagy valamely reakcióképes származékát vízelvonó vagy a savat aktiváló szer jelenlétében egy (VII) általános képletű aminnal – a képletben R_8 és R_9 azonosak vagy egymástól eltérőek lehetnek, és hidrogénatomot vagy 1–4 szénatomos alkilcsoportot jelentenek vagy együtt morfolingyűrűt alkotnak – vagy valamely reakcióképes származékával reagáltatjuk, majd kívánt esetben az így kapott olyan (I) általános képletű vegyületet, amelynek képletében R_1 és/vagy R_4 cianocsoportot jelent a megfelelő olyan (I) általános képletű vegyületté alakítjuk, amelynek képletében R_1 és/vagy R_4 összesen 2–4 szénatomos alkoxi-karbonilcsoportot, vagy amino-karbonilcsoportot jelent és/vagy

az olyan (I) általános képletnek megfelelő vegyületet, amelynek képletében R_4 és/vagy R_1 helyén karboxicsoport van, észterezéssel a megfelelő olyan (I) általános képletű vegyületté alakítjuk, amelynek képletében R_4 összesen 2–4 szénatomos alkoxi-karbonilcsoportot jelent és/vagy R_1 2–4 szénatomos alkoxi-karbonilcsoportot jelent és/vagy

az így kapott olyan (I) általános képletű vegyületet, amelynek képletében R_4 alkanoil-aminocsoportot jelent, hidrolízissel a megfelelő olyan (I)

általános képletű vegyülettől alakítjuk, amelynek képletében R_4 aminocsoportot jelent és/vagy az így kapott olyan (I) általános képletű vegyületet, amelynek képletében R_4 nitrocsoportot jelent, redukcióval a megfelelő olyan (I) általános képletű vegyülettől alakítjuk, amelynek képletében R_4 aminocsoportot jelent és/vagy

az így kapott olyan (I) általános képletű vegyületet, amelynek képleteben R_4 aminocsoportot jelent, diazóniumsóvá való átalakítással és az ezt követő melegítéssel a megfelelő olyan (I) általános képletű vegyületté alakítjuk, amelynek képletében R_4 hidroxicsoportot jelent és/vagy

az így kapott olyan (I) általános képletű vegyületet, amelynek képleteben R_4 aminocsoportot jelent, karbamoilezással a megfelelő olyan (I) általános képletű vegyületté alakítjuk, amelynek képleteben R_4 amino-karbonil-amino- vagy alkil-amino-karbonil-aminocsoportot jelent és/vagy

az így kapott olyan (I) általános képletű vegyületet, amelynek képletében R_4 alkoxi-karbonilcsoportot jelent, amidálással a megfelelő olyan (I) általános képletű vegyületté alakítjuk, amelynek képletében R_4 amino-karbonil- vagy alkil-amino-karbonilcsoportot jelent és/vagy az így kapott olyan (I) általános képletű vegyületet, amelynek képletében R_4 alkoxi-karbonilcsoportot jelent, redukcióval a megfelelő olyan (I) általános képletű vegyületté alakítjuk, amelynek képletében R_4 hidroxi-metilcsoportot jelent és/vagy

az így kapott (I) általános képletű vegyületet savaddíciós sójává, elsősorban szervetlen vagy szerves savakkal képzett, fiziológiaileg elviselhető savaddíciós sójává alakítjuk. (Elsőbbsége: 1983. 06. 30.)

2. Eljárás az (I') általános képletű imidazol-származékok – a képletben

A₄ és B₄ közöttük levő két szénatommal együtt (g) vagy (d) képletű vagy (j) általános képletű csoportot jelent; utóbbi képletben R_{4a} hidrogén- vagy 40 halogénatomot, trifluor-metil-, ciano- vagy 1-3 szénatomos alkoxicsoportot jelent,

R₁, alkánszulfonil-oxi-, alkánszulfonil-amino-, N-alkil-alkánszulfonil-amino-, alkil-szulfenil-metil-, alkil-szulfinit-metil- vagy alkil-szulfonil-metilcsoportot jelent, és a csoportokban az alkilrész 1–3 szénatomos; továbbá alkoxi-, amino-, alkil-amino- vagy dialkil-aminocsoporttal szubsztituált karbonilcsoportot jelent, és az alkilrész 1–3 szénatomos; továbbá amino-, az alkilrészben 1–2 szénatomos dialkil-amino- vagy morfolinocsoporttal szubsztituált szulfonilcsoportot jelent, továbbá 1–4 szénatomos alkil-amino-szulfonil-, nitro- vagy cianocsoportot jelent,

R_2 1-2 szénatomos alkoxi- vagy az alkílrészben 55
1-2 szénatomos dialkil-aminocsoportot és

R₃ hidrogénatomot vagy 1-3 szénatmos alkoxicscsoportot jelent – tautomerjeik és savaddíciós sóik, elsősorban szeretlen vagy szerves savakkal képzett, fiziológiailag elviselhető savaddíciós sóik előállítására, *azzal jellemzve, hogy*

a) adott esetben a reakcióegyenlőtlenségen kívül más, valamely (IIa) általános képletű vegyületet – a képletben

A_a és B_a jelentése a tárgyi körben megadott, X_a és Y_a jelképek közül az egyik hidrogénatomot jelent és a másik vagy az X_a és az Y_a jelképek mindegyike (k) általános képletű csoportot jelent, a képletben R_{1a}-R_{4a} jelentése a tárgyi körben megadott, Z_{1a} és Z_{2a}, amelyek egymással egyezők vagy egymástól eltérők lehetnek, adott esetben szubsztituált aminocsoportokat vagy adott esetben kis szénatomszámú alkilcsoportokkal szubsztituált hidroxi- vagy merkaptocsoportokat jelentenek vagy Z_{1a} és Z_{2a} együtt egy oxigén- vagy kénatomot, adott esetben 1-3 szénatomos alkilcsoporttal szubsztituált iminocsoportot, 2-3 szénatomos alkilén-dioxi- vagy alkilén-ditiocsoportot jelent – gyűrűzárással vetünk alá, vagy

b) olyan (I') általános képletű vegyületek előállítására, amelyek képleteben R_{1a} alkil-szulfinitil-metil- vagy alkil-szulfonil-metilcsoportot jelent, A_a , B_a , R_{2a} és R_{3a} a fenti, egy az a) eljárás szerint kapott (IIIa) általános képletű vegyületet oxidálunk – a képletben A_a , B_a , R_{2a} és R_{3a} jelentése a tárgyi körben megadott és

R₁, olyan alkil-szulfenil-metil- vagy alkil-szulfenil-metil-csoportot jelent, amelyben az alkilrész 1-3 szénatatomos -, vagy

c) olyan (I') általános képletű vegyületek előállítására, amelyek képletében R_{1a} alkánszulfonil-oxi-, alkánszulfonil-amino- vagy N-alkil-alkánszulfonilaminocsoportot jelent, A_a , B_a , R_{2a} és R_{3a} a tárgyi körben megadott, egy (IVa) általános képletű vegyületet – a képletben A_a , B_a , R_{2a} és R_{3a} jelentése a tárgyi körben megadott és R''_{1a} hidroxi-, amino- vagy olyan N-alkil-aminocsoportot jelent, amelynek alkilrésze 1–3 szénatomos – egy (Va) általános képletű szulfonsavvál vagy reakcióképes származékával reagáltatjuk – amely képletben R_{7a} 1–3 szénatomos alkilcsoportot jelent – vízelvonószer és/vagy a savat vagy az amint aktiváló szer jelenlétében vagy

d) olyan (I') általános képletű vegyületek előállítására, amelyek képletében R_{1a} amino-, alkilamino- vagy dialkil-aminocsoporttal szubsztituált karbonilcsoportot vagy amino-, dialkil-amino- vagy morfolinocsoporttal szubsztituált szulfonilcsoportot vagy alkil-amino-szulfonil-csoportot jelent, A_a , B_a , R_{2a} és R_{3a} a tárgyi körben megadott, egy (VIIa) általános képletű vegyületet – a képletben A_a , B_a , R_{2a} és R_{3a} jelentése a tárgyi körben megadott és R_{1a} karboxil- vagy hidroxi-szulfonilcsoportot jelent – vagy reakcióképes származékát vízelvonó- vagy a savat aktiváló szer jelenlétében egy (VIIa) általános képletű aminnal – a képletben R_{8a} és R_{9a} azonosak vagy egymástól eltérőek lehetnek, hidrogénatomokat vagy 1-4 szénatomos alkilcsoportokat jelentenek vagy együtt morfolinogyűrűt alkotnak – vagy reakcióképes származékával reagáltatjuk, majd kivánt esetben az így kapott olyan (I') általános képletű vegyületet, amelynek képletében R_{1a} cianocsoportot jelent, olyan (Ia) általános képletű vegyületté alakítjuk, amelynek képletében R_{1a} összesen 2-4 szénatomos alkoxi-karbonilcsoportot jelent és/vagy az így kapott (I') általános képletű vegyületet savaddíciós sójává, különösen szervetlen

vagy szerves savakkal képzett, fiziológiaileg elviselhető savaddiciós sójává alakítjuk. (Elsőbbsége: 1982. 07. 01.)

3. Az 1. vagy 2. igénypont szerinti bármely eljárás *azzal jellemezve*, hogy a reakciót oldószerben hajtjuk végre. (Elsőbbsége: 1983. 06. 30.)

4. Az 1. igénypont szerinti a) eljárás, a 2. igénypont szerinti a) eljárás vagy a 3. igénypont szerinti eljárás *azzal jellemezve*, hogy a reakciót 0 °C és 250 °C közötti hőmérsékleten hajtjuk végre. (Elsőbbsége: 1983. 06. 30.)

5. Az 1. igénypont szerinti a) eljárás, a 2. igénypont szerinti a) eljárás *azzal jellemezve*, hogy a gyűrűzárást a reakcióegy forráspontján hajtjuk végre. (Elsőbbsége: 1983. 06. 30.)

6. Az 1. igénypont szerinti a) eljárás, a 2. igénypont szerinti a) eljárás, a 3., 4. vagy 5. igénypontok szerinti eljárás *azzal jellemezve*, hogy a gyűrűzárást valamely kondenzálószer vagy bázis jelenlétében hajtjuk végre. (Elsőbbsége: 1983. 06. 30.)

7. Az 1. igénypont szerinti b) eljárás, a 2. igénypont szerinti b) eljárás vagy a 3. igénypont szerinti eljárás *azzal jellemezve*, hogy a reakciót -80 °C és 100 °C közötti hőmérsékleten hajtjuk végre. (Elsőbbsége: 1983. 06. 30.)

8. Az 1. igénypont szerinti c) eljárás, a 2. igénypont szerinti c) eljárás vagy a 3. igénypont szerinti eljárás *azzal jellemezve*, hogy a reakciót 0 °C és

100 °C közötti hőmérsékleten hajtjuk végre. (Elsőbbsége: 1983. 06. 30.)

9. Az 1. igénypont szerinti d) eljárás, a 2. igénypont szerinti d) eljárás vagy a 3. igénypont szerinti eljárás *azzal jellemezve*, hogy a reakciót -25 °C és 250 °C közötti hőmérsékleten hajtjuk végre. (Elsőbbsége: 1983. 06. 30.)

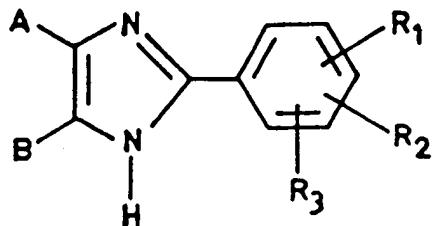
10. Eljárás egy vagy több (I) általános képletű imidazol-származékot vagy fiziológiaileg elviselhető savaddiciós sóját – a képletben A, B, R₁, R₂ és R₃ jelentése az 1. igénypont tárgyi körében megadott – hatóanyagként tartalmazó gyógyszerkészítmények előállítására *azzal jellemezve*, hogy az 1. igénypont szerinti bármelyik eljárással előállított hatóanyagot a gyógyszerkészítményekben szokásos hordozó-, hígító-, töltő- és/vagy egyéb segédanyaggal együtt kikészítjük. (Elsőbbsége: 1983. 06. 30.)

11. Eljárás egy vagy több (I') általános képletű imidazol-származékot vagy fiziológiaileg elviselhető savaddiciós sóját – a képletben A₁, B₁, R_{1a}, R_{2a} és R_{3a} jelentése a 2. igénypont tárgyi körében megadott – hatóanyagként tartalmazó gyógyszerkészítmények előállítására *azzal jellemezve*, hogy a 2. igénypont szerinti bármelyik eljárással előállított hatóanyagot a gyógyszerkészítményekben szokásos hordozó-, hígító-, töltő- és/vagy egyéb segédanyaggal együtt kikészítjük. (Elsőbbsége: 1982. 07. 01.)

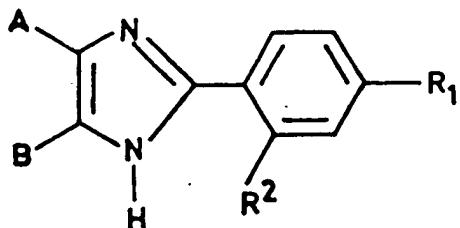
30

4 oldal rajz

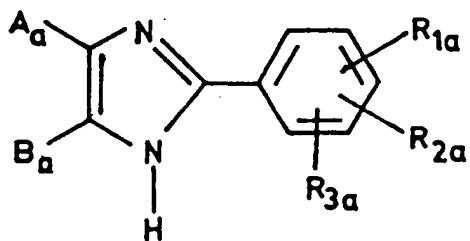
NSZO₄: C 07 D 471/04
 C 07 D 235/18
 C 07 D 473/00
 A 61 K 31/415



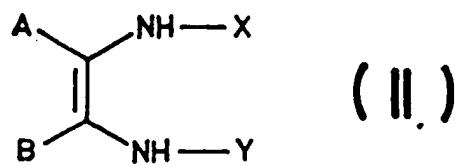
(I)



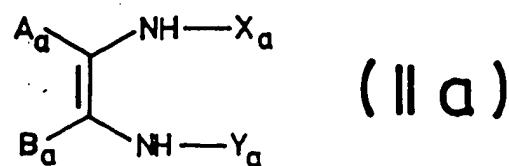
(Ia)



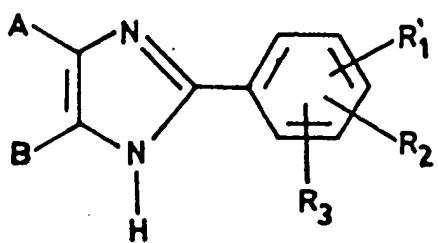
(I')



(II)

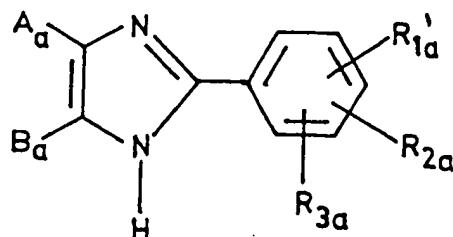


(IIa)

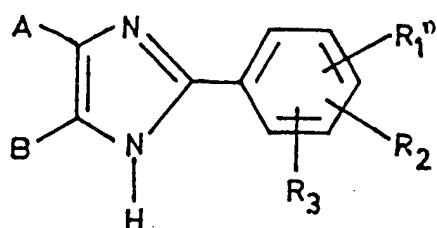


(III)

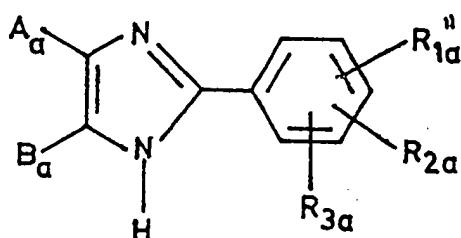
NSZO₄: C 07 D 471/04
 C 07 D 235/18
 C 07 D 473/00
 A 61 K 31/415



(IIIa)



(IV)



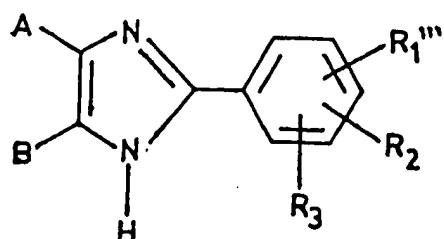
(IVa)

 $R_7 \rightarrow SO_3H$

(V)

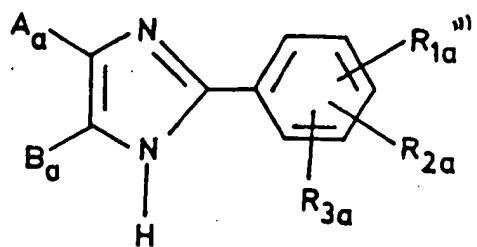
 $R_{7a} \rightarrow SO_3H$

(Va)

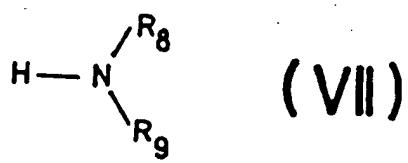


(VI)

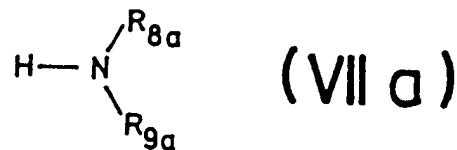
NSZO₄: C 07 D 471/04
 C 07 D 235/18
 C 07 D 473/00
 A 61 K 31/415



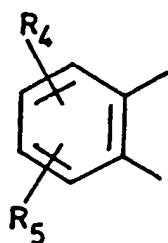
(VIa)



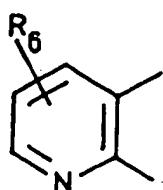
(VII)



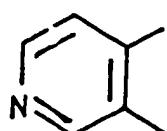
(VIIa)



(a)



(b)



(c)

ABSTRACT

Process for preparing new imidazole derivatives

The invention relates to a process for preparing new imidazole derivatives of formula //, further tautomers and acid addition salts thereof resp.; in the formula A and B with the two carbon atoms mean one of the groups (a)-(d); in such groups R4 stands for a hydrogen or halogen atom, an alkyl, -OH, alkoxy, trifluor-methyl, -CN, alkoxy-carbonyl, amino-carbonyl, alkyl-amino-carbonyl, HO-alkyl, nitro, amino, alkanoyl-amino, alkoxy-carbonyl-amino, amino-carbonyl-amino, alkyl-amino-carbonyl-amino, alkansulphonyl-amino group,
R5 means a hydrogen or halogen atom, an alkyl or alkoxy group and
R6 means a hydrogen or halogen atom or an alkyl group,
R1 stands for an alkansulphonyl-oxy, trifluor-methansulphonyl-oxy, alkansulphonyl-amino, N-alkyl-alkansulphonyl-amino, trifluor-methansulphonyl-amino, N-alkyl-trifluor-methansulphonyl-amino, alkyl-sulphenyl-methyl, alkyl-sulphinyl-methyl or alkyl-sulphonyl-methyl; a carbonyl group substituted with an alkoxy, amino, alkyl-amino or dialkyl-amino group, a sulphonyl group substituted with an amino, alkyl-amino or morpholino group, and if A and B mean (a), (b) or (d) group, R1 stands also for a nitro or cyano group,
R2 means an alkoxy-, alkyl- or dialkyl-amino group, and
R3 means a hydrogen atom or an alkoxy group.

The alkyl groups present as substituents in the above groups contain 1-2, 1-3 and 1-4 carbon atoms.

The pharmaceutical compositions containing the imidazole derivatives of formula // as active ingredients may be used for the treatment of heart failures of different origin.

Rekord - (PN=(192152))/szabadal - PIPACS

1. oldal, összesen: 2

40.571

Érvénytelen

Ügyszám: P8302382
Közzétételi szám: 31210
Lajstromszám: 192152

Bejelenés napja: 1983.06.30

+ 88. VII. Ich illetetiz

Megadás meghirdetése: 1987.05.28 nem

Uniói elsőbbség: DE3224512 - 1982.07.01

~~Yia~~

NSZO: C07D-471/04; C07D-235/18; C07D-473/00; A61K-031/115

Cím: Eljárás úti imidazol-származékok előfelfüjtésre

Angol cím: PROCESS FOR PREPARING NEW IMIDAZOLE DERIVATIVES

Report by Dr. Karl Thomas Gschl, Bingen, Germany

Jugosau: Dr. Karl Thomas GmbH., Biberach an der Riß

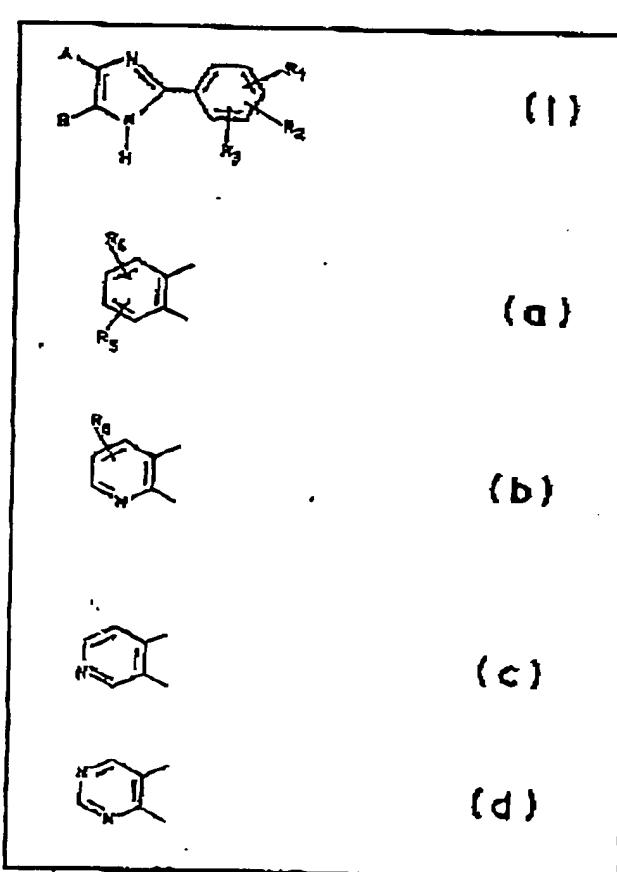
dr. Haucl, Norbert, Biberach/Riss, DE

dr. Austel, Volkhard, Biberach/Riss, D

dr. Diederer, Willi, Biberach/Riss, DE

dr. Reiffen, Manfred, Biberach/Riss, DE

dr. Heider, Joachim



Kivonat (közzétételi):

Rekord - (PN=(192152))/szabadal - PIPACS

2. oldal, összesen: 2

A találmány az (I) általános képletű új imidazolszármazékoknak, ezek tautomerjeinek és savaddíciós színak előállítására vonatkozik; a képletben

A és B a közöttük levő két szénatommal együtt (a), (b), (c) vagy (d) képletű csoportot jelent; a csoportokban

R4 hidrogén- vagy halogénatomot, alkil-, hidroxi-, alkoxi-, trifluor-metil-, ciano-, alkoxi-karbonil-, amino-karbonil-, alkil-amino-karbonil-, hidroxi-alkil-, nitro-, amino-, alkanoil-amino-, alkoxi-karbonil-amino-, amino-karbonil-amino-, alkil-amino-karbonil-amino-, alkán-szulfonil-amino csoportot,

R5 hidrogén- vagy halogénatomot, alkil- vagy alkoxicsoportot, és

R6 hidrogén- vagy halogénatomot vagy alkilcsoportot,

R1 alkánszulfonil-oxi-, trifluor-metánszulfonl-oxi-, alkánszulfonil-amino-, N-alkil-alkánszulfonil-amino-, trifluor-metánszulfonil-amino-, N-alkil-trifluor-metánszulfonil-amino-, alkil-szulfenil-metil-, alkil-szulfinitil-metil- vagy alkil-szulfonil-metilcsoportot, alkoxi-, amino-, alkil-amino- vagy dialkil-aminocsoporttal szubsztituált karbonilcsoportot, továbbá amino-, alkil-amino-, vagy morfolinocsoporttal szubsztituált szulfonilcsoportot, ha A és B (a), (b) vagy (d) csoport, nitro- vagy cián csoportot is,

R2 alkil-, alkoxi- vagy dialkil-aminocsoportot és

R3 hidrogénatomot vagy alkoxicsoportot jelent.

A fentiekben a helyettesítőkben lévő alkilcsoportok 1-2, 1-3, ill. 1-4 szénatomosak.

Az (I) általános képletű imidazol-származékokat hatóanyagként tartalmazó gyógyszerkészítmények különböző eredetű szívelégtelenségek kezelésére alkalmasak.